

⑩ 日本国特許庁 (J P)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭60-226868

⑬ Int. Cl.⁴

C 07 D 293/12
A 61 K 31/41
31/425

識別記号

ABG

庁内整理番号

7330-4C
7330-4C
7330-4C

⑭ 公開 昭和60年(1985)11月12日

※審査請求 未請求 発明の数 3 (全24頁)

⑮ 発明の名称 ベンズイソセレナゾールチオン類の製法

⑯ 特 願 昭60-37804

⑰ 出 願 昭60(1985)2月28日

優先権主張 ⑱1984年3月1日⑲西ドイツ(DE)⑳P3407511.9

㉑ 発 明 者 アンドレ・ヴェルテル ドイツ連邦共和国デー-5024プルハイム・ライエルヴェーク11アー

㉒ 出 願 人 アー・ナッターマン・ウント・シー・ゲゼルシャフト・ミット・ベシユレンクテル・ハフツング
ドイツ連邦共和国デー-5000ケルン30・ナッターマンアレー1

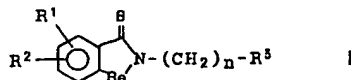
㉓ 代 理 人 弁理士 佐藤 辰男 外2名
最終頁に続く

明 細 書

1 発明の名称 ベンズイソセレナゾールチオン類の製法

2 特許請求の範囲

1) 一般式 I



(式中、R¹ および R² は同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、ハロゲン、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-アルコキシ、トリフルオロメチルまたはニトロであることができるかあるいは R¹ と R² は一絡になつてメチレンジオキンを表すことができ、n は 0 かまたは 1~4 の整数であり、R⁵ は水素原子、フェニル基を表すかあるいはハロゲン、アルキル、アルコキシ、トリフル

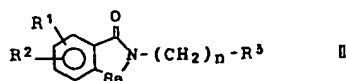
オロメチル、ニトロまたはメチレンジオキンをよりモノ置換またはジ置換されているフェニル基であるかあるいはチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、ベンゾトリアジン類、ベンゾチオフエン類、ベンゾチアジアゾール類、トリアジン類、トリアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、イソキノリン類、インドール類およびインダゾール類からなる群より選択され、しかもこれらがハロゲン、C₁~C₄-アルキル、C₁~C₄-アルコキシ、メルカプト、C₁~C₄-アルキルメルカプト、フェニル、ニトロおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる置換基に

りモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1~4個のヘテロ原子を有する複素環式基である)のベンズイソセレナゾールチオン類。

- 2) 式中、R¹およびR²が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していても水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいはR¹とR²が一緒になつてメチレンジオキシを表しそしてnが2~4の整数であり、他方R³が水素を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。
- 3) 式中、R¹およびR²が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していても水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいはR¹とR²が一緒になつてメチレンジオキシを表しそして

類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾール類およびテトラゾール類からなる群より選択され、しかもこれらが弗素、塩素、メチル、エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メルカプト、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ニトロ、フェニルまたはトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1~4個のヘテロ原子を有する複素環式基を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。

5) 一般式 II



てnが0かまたは1~4の整数であり、他方R³がフェニル基を表すかまたは弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロ、トリフルオロメチルまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換(置換基は同一でも異なつてもよい)されているフェニル基を表す前記特許請求の範囲第1項の記載によるベンズイソセレナゾールチオン類。

- 4) 式中、R¹およびR²が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していても水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいはR¹とR²が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができそしてnが0であり、他方R³がチオフェン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン

(式中、R¹、R²およびR³そしてnは前記特許請求の範囲第1項に記載の定義を有する)のベンズイソセレナゾロンを適当な芳香族炭化水素中においてそれ自体既知の方法で五硫化ニリんと反応させて相当するチオンを得ることを特徴とする前記特許請求の範囲第1~4項に記載された化合物の製法。

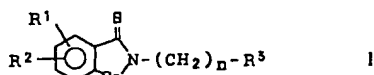
- 6) 式中のR¹、R²およびR³そしてnが前記特許請求の範囲第1項に記載の定義を有する一般式 II のベンズイソセレナゾロンを適当な芳香族炭化水素中においてそれ自体既知の方法で2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン(ラウエソン試薬)の作用により相当するチオンに変換することを特徴とする前記特許請求の範囲第1~4項の記載による化合物の製法。

7) 在来の製薬上の補助剤および佐薬と混合させた、活性化化合物としての前記特許請求の範囲第1～4項の記載による式1の化合物を含有することを特徴とする医薬製品。

5 発明の詳細な説明

本発明は新規ベンズイソセリナゾールチオン類、それらの製法およびリウマチ性型の炎症疾患治療用の医薬における活性化化合物としてのそれらの用途に関する。

本発明による化合物は一般式1



(式中、 R^1 および R^2 は同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、ハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ、トリフルオロメチルまたはニトロである

ル、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルコキシ、メルカプト、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキルメルカプト、フェニル、ニトロおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1～4個のヘテロ原子を有する複素環式基である)で表わされるものである。

好ましい化合物は式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができそして n が0かまたは1～4の整数であり、他方 R^3 が水素、フェニル基を表すかあるいは弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロ、トリフルオロメチルまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換(置換

ことができるかあるいは R^1 と R^2 は一緒になつてメチレンジオキシを表すことができ、 n は0かまたは1～4の整数であり、 R^3 は水素原子、フェニル基を表すかあるいはハロゲン、アルキル、アルコキシ、トリフルオロメチル、ニトロまたはメチレンジオキシによりモノ置換またはジ置換されているフェニル基であるかあるいはチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ピリダジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、ベンゾトリアジン類、ベンゾチオフエン類、ベンゾチアジアゾール類、トリアジン類、トリアゾール類、テトラゾール類、キノリン類、イソキノリン類、インドール類およびインダゾール類からなる群より選択され、しかもこれらがハロゲン、 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ -アルキ

基は同一であるかまたは異なっていることができる)されているフェニル基を表す化合物である。

これに加えてまた好ましい化合物は式中、 R^1 および R^2 が同一であるかまたは異なっており、しかも互いに独立していて水素、弗素、塩素、メチル、メトキシ、ニトロまたはトリフルオロメチルを表すかあるいは R^1 と R^2 が一緒になつてメチレンジオキシを表すことができ、 n が0であり、他方 R^3 がチオフエン類、チアゾール類、イソチアゾール類、イミダゾール類、ピラゾール類、チアジアゾール類、ピリジン類、ピリミジン類、ピラジン類、ベンゾチアゾール類、ベンズイミダゾール類、トリアジン類、トリアゾール類およびテトラゾール類からなる群より選択されしかもこれらが弗素、塩素、メチル、エチル、ブチル、メトキシ、エトキシ、メルカプ

ト、メチルメルカプト、エチルメルカプト、ニトロ、フェニルおよびトリフルオロメチルからなる群より選択される同一または異なる二つ以上の置換基によりモノ置換またはジ置換されうる、窒素および/または硫黄の元素である1~4個のヘテロ原子を有する複素環式基を表す化合物である。

本発明による化合物の例としては以下のものがあげられる。

2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-

ズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-ブチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(フェニルメチル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-フェニルブチル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイ

チオン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-エチル-1,2-ベン

ズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2

- (4-フルオロフェニル) - 1,2-ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2-
クロロフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (3-クロロフェ
ニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (4-クロロフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (2-トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (3-トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (2-メチルフェニル) - 1,2-ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3-
メチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (4-メチルフェ

ニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (2-メトキシフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (3-メトキシフェニル) - 1,2-ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
-メトキシフェニル) - 1,2-ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,4-ジメ
トキシフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (2,5-ジメトキ
シフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - チオン、2 - (3,4-ジメトキシフ
エニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (3,5-ジメトキシフェ
ニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (2,3-ジメチルフェニル) -
1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
ン、2 - (2,4-ジメチルフェニル) - 1,2-

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
- (2,5-ジメチルフェニル) - 1,2-ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,6
-ジメチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3,4-ジメ
チルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (3,5-ジメチルフ
エニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (2-クロロ-4-メチ
ルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (2-クロロ-6-メ
チルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (3-クロロ-2-
メチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - チオン、2 - (3-クロロ-4
-メチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4-クロロ-

2-メチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5-クロロ
-2-メチルフェニル) - 1,2-ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5-フル
オロ-2-メチルフェニル) - 1,2-ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4-
フルオロ-3-メチルフェニル) - 1,2-ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
-フルオロ-2-メチルフェニル) - 1,2-ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(3-フルオロ-4-メチルフェニル) - 1,2
-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
2 - (2-フルオロ-4-メチルフェニル) -
1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
ン、2 - (3-クロロ-4-フルオロフェニル)
- 1,2-ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (4-クロロ-3-フルオロフェニ

- 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,6 - ジメチル - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロロ - 5 - ニトロ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメルカプト - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ペンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - ペンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メトキシ - 2 - ペンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 2 - ペンゾチ

アゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ベン
 ゴチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 5 -
 ベンゴチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ -
 2 - ベンゴチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジ
 メチル - 2 - ベンゴチアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - チ
 アゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール -

3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - チ
 アゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2
 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2
 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2

- チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ
 - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メ
 チル - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メチ
 ル - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ
 - 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - クロロ -
 2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - メチル - 5
 - イソチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - イミダゾ
 リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (3 - ピラゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -

(1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (5 - メルカプト - 1,3,4 - チアジアゾ
 ール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メチル - 1,3,4
 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5
 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジアゾ
 ール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - 第3ブチル -
 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (2 - ピラジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ピリダ
 ジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベンズイミダゾ
 リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

- チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンズ
イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ベンゾトリア
ゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4 -
ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4
- ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (7
- フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 -
イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (7 - ニトロ - 1,2,4 - ベンゾ
トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベン
ゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - チオン、2 - (3 - ベンゾチエニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ

ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - テトラゾ
リル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- チオン、2 - (5 - キノリル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2-
メチル - 4 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニト
ロ - 5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - キノリル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (3 - キノリル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (8 -
キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 8 - キ
ノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (1 - イソキノリル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
ン、2 - (5 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズ

オン、2 - (2 - チエニル) - 1,2 - ベンズイ
ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2,1,3
- ベンゾチアジゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(1,2,4 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン -
4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4
- トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 -
ジフエニル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 - イル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
オン、2 - (5 - メルカプト - 1,2,4 - トリア
ゾール - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ

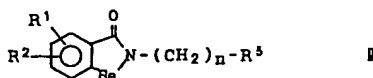
イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5
- インドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - イソインドリ
ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
チオン、2 - (5 - インダゾリル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
(6 - クロロ - 3 - インダゾリル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオンおよび
2 - (7 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - チオン。

本発明による式 I のベンズイソセレナゾール
チオン類は多数の病気の治療に使用されうる。
それらは特に免疫系を刺激する感染症の予防お
よび治療のためにおよび尤とえばヴェー・クラ
ウス氏 (W. Kraus) および P. オエーメ氏 (P.
Oehme) による「ダス・ドイト・ゲズントハイッ
グエーゼン (Das Deut. Gesundheitswesen)」

[ザ・ジャーマン・ヘルス・サービス(The German Health Service)], 1979, 34(37), 1713~1718および1979, 34(37), 1769~1773に定義されているようなセレン欠乏症の治療のために使用される。

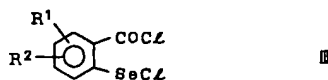
式Iのベンズイソセレナゾールチオン類は特にたとえば関節症または慢性多発関節炎のようになりウマチ性病気の治療に使用され、これら新規化合物は無毒性でありしかも既知の消炎性治療剤に対比して潰瘍形成または胃腸刺激を全く示さないの優れた耐性を有する点に特徴がある。

一般式Iの新規ベンズイソセレナゾールチオン類はそれ自体既知である方法で得られる。たとえば一般式II

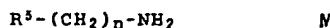


ム(Nouv. J. Chim.)」4, 47, 1980を参照されたい)。

出発化合物として使用される式IIのベンズイソセレナゾロン類は既知である[たとえばアール・レセル氏およびアール・バイス氏による「ベル(Ber.)」57(1924)、独国公開特許第3027,073号および同第3027,075号の各明細書参照されたい]かまたはそれらはこれらの参考書に記載の方法により、式III



(式中、R¹およびR²は式Iに記載の定義を有する)のo-クロロセレンベンゾイルクロライドを式M



(式中、R⁵およびnは式Iに記載の定義を有する)のアミンと反応させることにより得ること

(式中、R¹、R²およびR⁵そしてnは式Iに記載の定義を有する)の化合物を適当な溶媒中で加熱することにより五硫化二リンと反応させて相当するチオンを得る。この際70°~150℃、好ましくは80°~110℃の温度でたとえばベンゼン、トルエンまたはキシレンのような芳香族炭化水素を用いるのが好ましい。

式中、R¹、R²およびR⁵そしてnが式Iに記載の定義を有する一般式IIの化合物も出発物質として使用される別法では相当するチオンへの変換は70°~150℃、好ましくは110℃の温度での、たとえばトルエンまたはキシレンのような不活性溶媒中における2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン(ラウエソン試薬(Lawesson reagent)の作用により実施される(エル・シヤバナ氏等による「ユーブ・ジ・シ

ができる。前記の相当するo-クロロセレンベンゾイルクロライド類はA.ルウエット氏およびM.レンソン氏による「ブル・ソック・シム・ベルグ(Bull. Soc. Chim. Belg.)」1966, 75, 157~163に記載の方法にしたがつて製造される。

式IIの可能な出発化合物の例としてはたとえば以下のものがあげられる。

2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベ

ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、7 - メ
 トキシ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、5 - クロロ - 2 - エチ
 ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 オン、5 - メトキシ - 2 - エチル - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5 - ニト
 ロ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、4 - メトキシ - 2 - エチル
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 5,6 - ジクロロ - 2 - エチル - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6,7 - ジ
 クロロ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6,7 - メチレンジオキ
 シ - 2 - エチル - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、2 - ブチル - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (フエ
 ニルメチル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール

- 3(2H) - オン、2 - (4 - フェニルブチル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - オン、6 - クロロ - 2 - フェニ
 ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 オン、6 - フルオロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、6 - メ
 チル - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6 - メトキシ - 2 - フ
 エニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - オン、6 - トリフルオロメチル - 2 - フェニ
 ル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 オン、7 - メトキシ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5 - ク
 ロロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、5 - メトキシ - 2 - フ
 エニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

- オン、5 - ニトロ - 2 - フェニル - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、4 - メ
 トキシ - 2 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - オン、5,6 - ジクロロ - 2
 - フェニル - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - オン、6,7 - ジクロロ - 2 - フェニル
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 6,7 - メチレンジオキシ - 2 - フェニル -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (2 - フルオロフェニル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3 -
 フルオロフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、2 - (4 - フルオロフ
 エニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - オン、2 - (2 - クロロフェニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (3 - クロロフェニル) - 1,2 - ベンズイ

ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - ク
 ロロフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、2 - (2 - トリフルオロメ
 チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、2 - (3 - トリフルオロメ
 チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、2 - (4 - トリフルオロメ
 チルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、2 - (2 - メチルフェニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (3 - メチルフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4
 - メチルフェニル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、2 - (2 - メトキシフ
 エニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - オン、2 - (3 - メトキシフェニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン

ン、2-(4-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,3-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,4-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,5-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2,6-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-ジメチル

フェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3,5-ジメチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-クロロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-クロロ-6-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(5-クロロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(5-フルオロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、

2-(4-フルオロ-3-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-フルオロ-2-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-フルオロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-フルオロ-4-メチルフエニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、

2-(4-メトキシ-2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-4-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-メチル-2-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-3-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-メチル-5-ニトロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(2-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、2-(4-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンゾール-3(2H)-オン、6-クロロ

- 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、 6 - フルオロ - 2
- (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、 6 - メチル - 2 - (2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、 6 - メトキシ - 2 - (2 - ピ
リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、 6 - トリフルオロメチル - 2 -
(2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、 7 - メトキシ - 2 - (2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
- 3(2H) - オン、 5 - クロロ - 2 - (2 - ピリ
ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
- オン、 5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリジル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、 5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 4

- オン、 2 - (4 - メチル - 2 - ピリジル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
2 - (5 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (6
- メチル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (3,5 - ジ
クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセ
レナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (4,6 - ジメ
チル - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
ナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (5 - クロロ -
2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、 2 - (4 - クロロ - 2 - ピ
リジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
3(2H) - オン、 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6
- クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6 -

- メトキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 5,6 -
ジクロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベン
ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6,7 - ジ
クロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6,7 - メチ
レンジオキシ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 2 -
(2 - クロロ - 3 - ピリジル) - 1,2 - ベンズ
イソセレナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (2 -
メトキシ - 5 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
セレナゾール - 3(2H) - オン、 2 - (3 - ニト
ロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
ゾール - 3(2H) - オン、 2 - (5 - ニトロ - 2
- ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
ール - 3(2H) - オン、 2 - (3 - メチル - 2 - ピリ
ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

フルオロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -
ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6 -
メチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6 - メ
トキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 6 - ト
リフルオロメチル - 2 - (2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、 7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル)
- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
ン、 5 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
- ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、 4 -
メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、5,6
 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリミジ
 ニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - オン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オ
 ン、2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (4,6 - ジメチル - 2 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (2,6 - ジメチル - 4 - ピリミジニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4
 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ

ナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - クロロ -
 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - メトキシ
 シ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6 - メ
 トキシ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - メ
 チル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 -
 メチル - 5 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (6
 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(3H) - オン、2 -
 (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、
 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、6 - クロロ - 2 -

ル - 3(2H) - オン、2 - (4 - クロロ - 2 -
 メチルメルカプト - 6 - ピリミジニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2
 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミジニ
 ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 オン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピ
 リミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、2 - (2 - クロロ - 5 - ニト
 ロ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 - ジク
 ロロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 - ジ
 クロロ - 5 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4,6 -
 ジメルカプト - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2
 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ

(2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6 - フルオロ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、6 - メチル - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、6 - メトキシ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、6 - トリフルオロメチル - 2
 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - オン、7 - メトキシ - 2 -
 (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - オン、5 - クロロ - 2 - (2
 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾー
 ル - 3(2H) - オン、5 - メトキシ - 2 - (2 -
 チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - オン、5 - ニトロ - 2 - (2 - チア
 ザリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、4 - メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (4 - メチル - 2 -

チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - ニトロ - 2 -

チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 - クロロ - 2 -

チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3 -

メチル - 5 - イソチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 -

イミダゾリル) - 1,2 -

3(2H) - オン、2 - (2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - オン、2 - (5 - ベンゾトリアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 -

イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (1,2,4 -

ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 -

イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (2 -

ベンゾチエニル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (3 -

ピラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (1,3,4 -

チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (5 - メルカプト - 1,3,4 -

チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 - (5 -

トリフルオロメチル - 1,3,4 -

チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (3 - ベンゾチエニル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - オン、2 -

(2 - チエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (2,1,3 - ベンゾチアジアゾール - 4 -

イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (1,2,4 - トリアジン - 4 -

イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 -

トリアジン - 4 - イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4 -

トリアジン - 3 - イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (5,6 - ジフエニル - 1,2,4 -

トリアジン - 3 - イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 -

イル) - 1,2 -

ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -

オン、2 - (5 -

メル

カプト-1,2,4-トリアゾール-3-イル)-
 1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-テトラゾリル)-1,2-ベンズイソ
 セレナゾール-3(2H)-オン、2-(5-キノ
 リル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)
 -オン、2-(2-メチル-4-キノリル)-
 1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(6-ニトロ-5-キノリル)-1,2-ベ
 ンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、2-(2
 -キノリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール
 -3(2H)-オン、2-(3-キノリル)-1,2-
 ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、2-
 (8-キノリル)-1,2-ベンズイソセレナゾ
 ール-3(2H)-オン、2-(6-メトキシ-8
 -キノリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール
 -3(2H)-オン、2-(1-イソキノリル)-
 1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、

2-(5-イソキノリル)-1,2-ベンズイソ
 セレナゾール-3(2H)-オン、2-(5-イン
 ドリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-
 3(2H)-オン、2-(5-イソインドリル)-
 1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オン、
 2-(5-インダゾリル)-1,2-ベンズイソ
 セレナゾール-3(2H)-オン、2-(6-クロ
 ロ-3-インダゾリル)-1,2-ベンズイソセ
 レナゾール-3(2H)-オンおよび2-(7-イ
 ンダゾリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール
 -3(2H)-オン。

本発明による一般式Iのベンズイソセレナゾ
 ールチオン類は常套手段で製剤に調製されうる。
 活性成分として式Iのベンズイソセレナゾール
 チオン類を含有する製剤を調製するには活性化
 化合物はそのまま用いられうるかあるいは適当
 な製薬上の希釈剤および/または補助剤と組み

合わせて用いられついで常套手段で調製されう
 る。

人および獣の医薬の分野ではこの活性化化合物
 はたとえば全身にいずれか所望の形態で投与され
 るが、ただし適当なレベルの活性化化合物が血
 液中または組織中に存在または維持されることが
 保証される必要がある。これは適当な投与量
 における経口的、直腸的または非経口的な投与
 で達成されうる。この活性化化合物の製剤はた
 とえば錠剤、糖衣錠、カプセル、坐薬、ゾルまた
 はゲルのような所望の投与に適合される個々の
 投与量の形態で存在するのが有利である。これ
 ら化合物の投与量は通常、1日当たり10～
 1,000mg、好ましくは30～300mgであり、1日
 に1回または数回、好ましくは2～3回に分け
 て投与されうる。たとえば錠剤またはカプセル
 の形態あるいは顆粒または粉末の形態で経口的

に投与されうる剤の調製のために使用される適
 当な補助剤の例としてはたとえば炭酸カルシウ
 ム、りん酸カルシウム、澱粉、糖、ラクトース、
 タルク、ステアリン酸マグネシウム、ゼラチン、
 ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、ソルビ
 トール、微結晶性セルロース、ポリエチレング
 リコール、カルボキシメチルセルロース、シエ
 ラックなどがあげられる。これら製剤は常套手
 段で被覆されうる。経口用の液体製剤はシロッ
 プ、エリキシルなどの形態で、水性または油性
 の懸濁液または溶液の形態で存在しうる。これ
 らは常套手段で調製される。注射用製剤は水性
 または油性の懸濁液または溶液、使用前に溶解
 される充填剤と一緒になつた粉状組成物および
 凍結乾燥された製剤などであることができる。
 これらの製剤は常套手段で調製される。また本
 発明による製剤は直腸投与用の坐薬形態である

こともでき、それらはたとえはポリエチレングリコール、ラノリン、カカオバター、ウイテプゾル（登録商標、Witepsol）などとして知られている製薬的に許容しうる補助剤を含有することができる。外用薬剤は軟膏またはクリーム of 形態で調製されるのが好ましく、これらは通常の成分を使用して常套手段で調製される。

以下に本発明による化合物の製法を実施例によりより詳細に説明する。

実施例 1 2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン

15 ml のトルエン中における 2.75 g (0.01 モル) の 2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-オンおよび 2.06 g (0.0051 モル) の 2,4-ビス-(4-メトキシフェニル)-2,4-ジチオキソ-1,3,2,4-ジチアジホスフェタン（ラウエソン試薬）の混合物を 5 時間

フェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 187~188°C）、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 129°C）、6-フルオロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 101~103°C）、6-メチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 121~123°C）、6-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 159~161°C）、6-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 121~122°C）、5-ニトロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 154°C）、5-クロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融

100°C で加熱する。冷却後溶液を真空蒸留しついで油状残留物を 100 ml のエーテル/石油エーテル 25:75 (V/V) で 3 回抽出する。抽出溶液を蒸留した後残留物をシリカゲルカラム上に導入しついでトルエン/ヘキサン 7:3 (V/V) で溶離する。

収量: 1.71 g (理論量の 58.7%)、融点: 64~65°C (エタノールから再結晶後)。

以下の化合物が実施例 1 の方法と類似の方法で製造された。

2-(4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 55~56°C）、2-(4-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 67~69°C）、2-(4-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 64~66°C）、2-(4-ニトロ

点 128°C)、7-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 123~124°C）、6,7-メチレンジオキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 73°C）、2-(5-メチル-2-チアゾリル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 195~196°C）、2-(2,6-ジメチル-4-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 137~139°C）、2-(4,6-ジメチル-2-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 162~163°C）、2-(4,6-ジメチル-2-ピリジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点 141~143°C）、2-(5-クロロ-2-ピリジニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン（融点

171~173℃)、2-(2-メトキシ-5-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点135~136℃)、2-(2,6-ジクロロ-3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点101~102℃)、2-(2-ベンゾチアゾリル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点300~303℃)、2-(2-ピリミジニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点195~196℃)、2-(2-チアゾリル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点189~191℃)、2-(4-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点171~174℃)、2-(3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点179~180℃)、2-(2-ピリジル)-1,2-ベンズイソセ

レンアゾール-3(2H)-チオン(融点141~143℃)、2-(2-クロロ-3-ピリジル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点102~103℃)および2-(2-ピラジニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点181~184℃)。

実施例2 2-(3-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン

室温において200mlのキシレン中における18.3g(0.06モル)の2-(3-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオンの混合物に7g(0.03モル)の五硫化二りんを攪拌しながら少量ずつ加える。この反応混合物を7時間80℃に保つ。この澄んだ溶液を樹脂状残留物から傾瀉し、最初は炭酸水素ナトリウム水溶液について水で洗浄する。この溶

液を真空中で濃縮した後に残留物をエタノールから再結晶させる。

収量: 9.95g(理論量の51.6%)、融点: 51~52℃。

以下の化合物が実施例2の方法と類似の方法で製造された。

2-(2-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点55~57℃)、2-(3,4-メチレンジオキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点85~88℃)、2-(フェニルメチル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点41℃)、2-(4-フェニルブチル)-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(油状物)、2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(油状物)、2-(2-メチルフェニル)-1,2-ベン

ズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(融点65~67℃)および2-ブチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン(油状物)。

また以下の化合物が実施例1および2の方法と類似の方法で製造された。

6-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、6-フルオロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、6-メチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、6-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、7-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-チオン、5-クロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレンアゾール-3(2H)-

チオン、5-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-ニトロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-メチレンジオキシ-2-エチル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6-トリフルオロメチル-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、4-メトキシ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、5,6-ジクロロ-2-フェニル-1,2-

ゾール-3(2H)-チオン、2-(2,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,4-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,5-ジメトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,3-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,4-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,5-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2,6-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3,4-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾ-

-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、6,7-ジクロロ-2-フェニル-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-フルオロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-クロロフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-メトキシフェニル)-1,2-ベンズイソセレナ

ル-3(2H)-チオン、2-(3,5-ジメチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(2-クロロ-6-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(5-フルオロ-2-メチルフェニル)-1,2-ベンズイソセレナゾール-3(2H)-チオン、2-(4-

フルオロ - 3 - メチルフエニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
 - フルオロ - 2 - メチルフエニル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 (5 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - フルオロ - 4 - メチルフエニル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (4 - クロロ - 3 - フルオロフェニ
 ル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) -
 チオン、2 - (2 - ニトロフェニル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (3 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メ
 トキシ - 2 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズイ

ソル - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキ
 シ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ -
 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2
 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール
 - 3(2H) - チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ

ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 -
 メチル - 4 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4
 - メチル - 2 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - メチル - 3 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - メチル - 5 - ニトロフェニル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - ク
 ロロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオ
 ロ - 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル -
 2 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2
 - (2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメ

ソール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - ニトロ -
 2 - ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 -
 ピリジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (3 - メチル - 2 - ピリ
 ジル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)
 - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリジル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (5 - メチル - 2 - ピリジル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (6 - メチル - 2 - ピリジル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (3,5 - ジクロロ - 2 - ピリジル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (4 - クロロ - 2 - ピリジル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 -
 クロロ - 2 - (2 - ピリミジン) - 1,2 - ベン

ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオロメチル - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - クロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニトロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H)

ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 6 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - クロロ - 5 - ニトロ - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジクロロ - 5 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4,6 - ジメチルカプト - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル)

- チオン、4 - メトキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - ジクロロ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ニトロ - 2 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 4 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - クロロ - 2 - メチルメルカプト - 6 - ピリミジニル) - 1,2 - ベンズイ

- 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (4 - メチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 5 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 - ベンゾチアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - フルオロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ

レナゾール - 3(2H) - チオン、6 - メトキシ -
 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセ
 レナゾール - 3(2H) - チオン、6 - トリフルオ
 ロメチル - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、7 -
 メトキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 -
 クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - メ
 トキシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5 - ニ
 トロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、4 - メト
 キシ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベンズ
 イソセレナゾール - 3(2H) - チオン、5,6 - ジ
 クロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7 -

ル - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メルカプト -
 1,3,4 - チアジアゾール - 2 - イル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (5 - トリフルオロメチル - 1,3,4 - チアジ
 アゾール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - 第3級
 ブチル - 1,3,4 - チアジアゾール) - 1,2 - ベン
 ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2
 - ピリダジニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - ベンズイミ
 ダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 2 -
 ベンズイミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレ
 ナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - ペンゾ
 トリアゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (7 - クロロ - 1,2,4
 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベン

ジクロロ - 2 - (2 - チアゾリル) - 1,2 - ベ
 ンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、6,7
 - メチレンジオキシ - 2 - (2 - チアゾリル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (4 - メチル - 2 - チアゾリル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (5 - ニトロ - 2 - チアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (5 - クロロ - 2 - チアゾリル) - 1,2 -
 ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2
 - (3 - メチル - 5 - イソチアゾリル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - イミダゾリル) - 1,2 - ベンズイソ
 セレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - ピ
 ラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (1,3,4 - チアジアゾ
 ール - 2 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ

ズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 -
 (1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) -
 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオ
 ン、2 - (7 - フルオロ - 1,2,4 - ベンゾトリ
 アジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナ
 ザール - 3(2H) - チオン、2 - (7 - ニトロ -
 1,2,4 - ベンゾトリアジン - 3 - イル) - 1,2
 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、
 2 - (2 - ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイ
 ソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 -
 ベンゾチエニル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾ
 ール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - チエニル)
 - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チ
 オン、2 - (2,1,3 - ペンゾチアジアゾール -
 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -
 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4 - トリアジン -
 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - チオン、2 - (2,6 - ジメルカプト - 1,3,5 - トリアジン - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジメチル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5,6 - ジフェニル - 1,2,4 - トリアジン - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (1,2,4 - トリアゾール - 4 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - メルカプト - 1,2,4 - トリアゾール - 3 - イル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - テトラゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - メチル - 4 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

3(2H) - チオン、2 - (6 - ニトロ - 5 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (2 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (3 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (8 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (6 - メトキシ - 8 - キノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (1 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - イソキノリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - インドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - イソインドリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン、2 - (5 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール -

ル - 3(2H) - チオン、2 - (6 - クロロ - 3 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオンおよび 2 - (7 - インダゾリル) - 1,2 - ベンズイソセレナゾール - 3(2H) - チオン。

特許出願人 アー・ナツターマン・ウント・
シー・ゲゼルシャフト・ミット・
ベシユレンクテル・ハフツング

代理人 弁理士 佐藤辰 

同 弁理士 高木千 

同 弁理士 西村公 

第1頁の続き

⑤Int. Cl. ⁴	識別記号	庁内整理番号
A 61 K 31/44	A B E	6664-4C
31/495		6664-4C
31/505		6664-4C
C 07 D 421/04		7431-4C
517/04		8214-4C
//(C 07 D 421/04		7431-4C
213:00		7138-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
239:00		7166-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
277:00		7330-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
241:00		7166-4C
293:00)		7330-4C
(C 07 D 421/04		7431-4C
293:00.		7330-4C
317:00)	8214-4C	
(C 07 D 517/04	8214-4C	
293:00	7330-4C	
317:00)	8214-4C	
⑥発 明 者	ジーグルト・ライツク	ドイツ連邦共和国デー5024プルハイム2アム・クヴェツ ヒエンハウフ21
⑦発 明 者	オイゲン・エツチエン ベルク	ドイツ連邦共和国デー5000ケルン41・ヒルゼヴェーク10